

PROCESS FOR THE PREPARATION OF TETRA-SUBSTITUTED BENZENE DERIVATIVES

Publication number: KR950002083 (B1)

Also published as:

Publication date: 1995-06-16

 ZA8167662 (A)

Inventor(s): SHINMA NOBUO [US]; OHTSUKA TATSUO [US]; FUJII MORIO [US]; ISHITSUKA HIDEO [US]; DANZI ZENKYO [US]; SUHARA YASUJI [US]; *

 JP57122039 (A)

 ES8307200 (A1)

Applicant(s): HOFFMANN LA ROCHE & W A G F [CH]; *

Classification:

- international:

A61K31/075; A61K31/12; A61K31/13; A61K31/185;
A61K31/219; A61K31/22; A61K31/34; A61K31/48; A61K31/70;
A61P31/12; C07C231/06; C07C231/02; C07C313/12;
C07C236/66; C07C236/00; C07C251/48; C07C313/00;
C07C323/22; C07C323/02; C07C325/00; C07C325/02;
C07C327/48; C07C48/00; C07C48/15; C07C49/84;
C07C67/00; C07C68/025; C07C68/06; C07D207/33;
C07D207/40; C07D213/40; C07D307/12; C07D307/46;
C07D307/66; C07D317/54; C07D317/58; C07D333/14;
C07F9/12; C07H15/203; A61K; A61K31/075; A61K31/12;
A61K31/16; A61K31/166; A61K31/21; A61K31/34; A61K31/66;
A61K31/70; A61P31/00; C07C; C07C231/00; C07C235/00;
C07C236/00; C07C251/00; C07C313/00; C07C323/00;
C07C325/00; C07C327/00; C07C45/00; C07C49/00;
C07C67/00; C07C68/00; C07D207/00; C07D213/00;
C07D307/00; C07D317/00; C07D333/00; C07F9/00;
C07H15/00; IPC1-7; C07C43/04

- European:

Application number: KR19950004410 199511112

Priority number(s): GB19800038223 19801112

Abstract of KR 950002083 (B1)

Tetra-subst. benzene derivs. of formula (I) and their pharmaceutically utilisable salts are prepared by reacting the reactive carboxylic acid derivs. of formula (II) with the cpd. of formula (IV), and then removing the protecting group of the protected hydroxyl radical in formulae, X is oxygeno; R1 is hydroxy, acyloxy or lower alkoxy; R2 is lower alkoxy, lower alkenyloxy or lower alkylthio, R3 is lower alkyl; R4 is lower alkyl or *p*-lower-alkoxybenzoyl, opt. subst. phenyl or benzyl gp.; R5 is protected hydroxyl radical

Data supplied from the **espacenet** database — Worldwide

TETRASUBSTITUTED BENZENE DERIVATIVES

Publication number: JP57122039 (A)

Publication date: 1982-07-28

Inventor(s): NIKKAA NOBUO; FUJIO MORIO, UMEDA ISAO, OOTSUKA TATSUO, ISHIZUKA HIDEO, SUHARA KOUJI

Applicant(s): HOFFMANN LA ROCHE

Classification:

international: C07C69/025; A61K31/075; A61K31/12; A61K31/15; A61K31/165; A61K31/215; A61K31/22; A61K31/34; A61K31/06; A61K31/70; A61P31/12; C07C45/00; C07C48/175; C07C48/04; C07C57/00; C07C69/96; C07C231/00; C07C231/02; C07C231/12; C07C235/58; C07C239/00; C07C251/48; C07C313/00; C07C323/22; C07C323/62; C07C323/00; C07C325/02; C07C327/48; C07D207/02; C07D207/40; C07D213/40; C07D307/12; C07D307/48; C07D307/68; C07D317/54; C07D317/58; C07D333/14; C07F9/12; C07H15/203; A61K; A61K31/075; A61K31/12; A61K31/15; A61K31/165; A61K31/21; A61K31/24; A61K31/66; A61K31/70; A61P31/00; C07C; C07C48/00; C07C48/09; C07C57/00; C07C69/00; C07C231/00; C07C233/00; C07C323/00; C07C325/00; C07C327/00; C07D207/00; C07D213/00; C07D307/00; C07D317/00; C07D333/00; C07F9/00; C07H15/00; (IPC-17) A61K31/12; A61K31/15; A61K31/165; A61K31/215; A61K31/24; A61K31/66; A61K31/70; C07C48/04; C07C69/035; C07C69/08; C07C103/75; C07C131/00; C07C149/32; C07C151/00; C07C153/05; C07C181/00; C07D207/333; C07D213/40; C07D307/48; C07D317/54

Also published as:

ZA8107602 (A)
KR890602583 (B1)
ES8307206 (A1)

European:

Application number: JP15610179679 19811111

Priority number(s): GB19800036223 10801112

Abstract not available for JP 57122039 (A)

Data supplied from the esp@cenet database — Worldwide

8. Xが陰炭素原子もしくは窒素原子またはセドロンイイノ基を示し、Yがメチレン基またはイイノ基を示し、R¹が炭素基、ホスホノ基、シリコンノ基、アルル化されたシリコンノ基、アルロキシル基または低級アルロキシル基を示し、R²が低級アルロキシル基または低級アルル化基を示し、R³が低級アルロキシル基、ア、低級アルロキシルベンゾイル基または低級イイノ基または低級アルル化基、ベンジル基、アリールメチル基、フルアリル基、テトラヒドロフルアリル基、フェニル基、テトラヒドロフェニル基、ピロリルメチル基、ピロリルメチル基またはピロリルメチルメチル基を示し、但し、R⁴がアルル基、フェニル基、低級フェニル基、ベンジル基またはピロロキチンベンゾイル基を示す場合には、Yがメチレン基を示すことはなく、逆または、R⁴がア

- 3 -

1. 5-エトキシ-3-メトキシフェニル 二官能ホスフェートおよびそのナトリウム塩である特許請求の範囲第1項記載の化合物。

7. 1. {4-エトキシ-3-ヒドロキシ-6-メトキシフェニル}-3-{4-メトキシフェニル}-1-プロパノールである特許請求の範囲第1項記載の化合物。

8. 5-エトキシ-3-メトキシ-6-3-{3-メトキシフェニル}プロピオールフェニル プレートである特許請求の範囲第1項記載の化合物。

9. 2-ヒドロキシ-4,6-ジメチル-N-{2-{4-メチルオキ}ベンジル}ベンゾアミドである特許請求の範囲第1項記載の化合物。

10. 2-{[3-アリルオキ}ベンジル]アミノ}カルボニル-3,3-ジメチルフェニル ベンゾアミドである特許請求の範囲第1項記載の化合物。

- 5 -

11. 2-ヒドロキシ-4,6-ジメチル-N-{2-{4-メチルオキ}ベンジル}ベンゾアミドである特許請求の範囲第1項記載の化合物。

3. R¹が炭素基、低級アロキシルオキシル基、ベンゾイルオキシル基、ホスホノ基、低級アルロキシルまたは低級アルル化基を示し、R²が低級アルロキシル基を示し、R³が低級アルロキシル基を示し、R⁴が低級アルロキシル基を示し、Xが陰炭素原子または窒素原子を示し、Yがメチレン基またはイイノ基を示す特許請求の範囲第1項記載の化合物。

4. Yがイイノ基を示す特許請求の範囲第1項記載の化合物。

5. 4-エトキシ-2-ヒドロキシ-3-メトキシ-N-{3-メトキシベンジル}ベンゾアミドである特許請求の範囲第1項記載の化合物。

6. 2-{[3-アリルオキ}ベンジル]カルボニル}

- 4 -

1項記載の化合物。

11. 1-{4-エトキシ-3-ヒドロキシ-6-メトキシフェニル}-3-{4-メトキシフェニル}-1-プロパノールである特許請求の範囲第1項記載の化合物。

12. 5-エトキシ-3-メトキシ-2-{3-{4-メトキシフェニル}-プロピオール}フェニル プレートである特許請求の範囲第1項記載の化合物。

13. 2-ヒドロキシ-6-メトキシ-N-アロキシル-N-{3-メトキシベンジル}ベンゾアミドである特許請求の範囲第1項記載の化合物。

14. 4-{[3-アリルオキ}ベンジル]アミノ}カルボニル-2-ヒドロキシ-6-メトキシ-N-{3-メトキシベンジル}ベンゾアミドである特許請求の範囲第1項記載の化合物。

15. 2-ヒドロキシ-6-メトキシ-4-

- 6 -



〔式中、 U 、 V 、 W 、 X 、 Y 、 Z 係此式に於ける
各二面角の餘弦を有する〕

の了解：フェノンを溶かし蒸と取らせ、得られる
油を調整装置のアンモニアと反応させるか。

40 新報中民で増進の爲に下代一親成



〔武甲、 R^1 、 R^2 および R^3 は式(1)に於ける
基と側鎖の置換を要する。〕

乙 工 次 予 入 會 經 催 展 院 經 律 事 記

(4) 普通車代り一般に



（流中、 Y 、 R^2 、 R^4 および R^6 形式に可
なり）と同様の展開を施し、 X' は無差
子も死に無差子を収める）

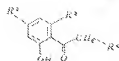
のフエノ一山を丁ノ山と號し、此處有山あり。

(4) 溶解液中に塩基の存在下に樹形式のフエノールをオキシ塩化リンを添加シベンゾル系エポキシドポリマーと反応させ、併いで溶解より、加水分解して水相中分解し、誘導により、得られる化合物を更に乾燥する。減圧下

(4) 部屋の中で船旅の存続下に前記のもののエノールをアシル化されているというタリウムハライドと反応させ、次いで、加熱すると、ブシム酸を生成する。

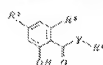
ことなす時故とすも特許法學の範圍落し強記教の式
1の化台曲と云ふそれらの教養學の所屬しうも
強の義指乃術。

5.0. 智行請求の総額集：積込数式：の付合

[illegible]

のケトン金とドロやフルミンの酸と炭素させる
か。

(1) 溶解中にて塩基の存在下にて一般式



1. 式中、 β 、 β^2 、 β^3 および β^4 の値（概
おける）と機械の形状を問うる。

約カルボニル化合物を環化リンと反応させる。

(d) 證明存在下列一式



御またはそれらの数値的におおしる値の少々
くとも一種を活性成分として含有する数値的の組
成物。

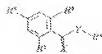
2.4 特許制度の経緯(1) 近代化の途への社会
 意は大正それらの新機軸の時代、この社会の政治
 経済のメカニズム改革の絶頂を待たずして。

2.2 特許請求の範囲と：8 項記載の製造方法
またはそれらの明かに化学的に同等な方法によ
つて製造した特許請求の範囲：炭酸の式：(の
化合物またはそれらの物理学的的性質しうる環

3 雜項的獎勵和脫團

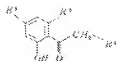
[illegible]

時代著しく、本誌版は… 824



(式中、 Y 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、および R^4 は式(1)に

おけると同様の意味を有し、 X^1 は酸素原子または硫黄原子を示す)

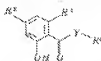


(1)

(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 は式(1)に
おけると同様の意味を有する)

のケトン基とヒドロキシル基との間と反応させるも
可、

(f) 前項中にて環基の存在下で、一般式

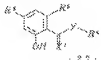


(2)

(式中、 Y 、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 は式(1)
に おけると同様の意味を有する)

のカルボニル化合物を硫酸化リンと反応させるも、

(g) 前項の存在下で一般式



(3)

(2)

式(2)で処理することによつて行うことが出来る。

前項(4)に言う反応は、式(1)のカルボン酸の反応
性換換体を含むものとして反応させ、或いて得ら
れる化合物の保護された化合物の保護内分を除去
することによつて行うことが出来る。かかる式(1)
のカルボン酸の反応性換換体の好ましい例として
は、氯化アセチル、臭化アセチル等のハロゲン化ア
セチルおよび N -ヒドロキシブタンイミドエステル、
 α -エチロキシカルボキシ酸等の環状エステルで
ある。保護された化合物の保護部分の除去は、そ
れ自体公知の方法によつて行うことが出来る。

前項(5)に言う反応は前項(4)に於てある。この反
応を行う時は、昇温下でシリコン、ケタレン等の
多孔性アミン中で或る量のアセトフェノンを溶
媒と反応させ、或いて得らるべき量を減らすの
と反応させる。

前項(6)に言う環基は前項(4)に於ける、ベンゼン、

のフエノールをアセチル化剤と反応させるも、

(h) 前項中にて環基の存在下で前項(5)のフエ
ノールをケトン基硫酸化リンまたは硫酸化リン
と反応させ、或いて、必要により、
加水分解または加水分解し、前項(4)より、得ら
れる化合物を硫酸化リンと反応させるも、或いは

(i) 前項中にて環基の存在下で前項(5)のフエ
ノールをアセチル化されていても或はシリコン
と反応させ、或いて、必要により、アセチ
ルを除去する

ことにより製造する。

前項(4)に言う水素源は、酢酸(例えば酢酸
ホルム)中で触媒(例えばパラジウム酸、 α - β -
ジウムカルボノール)の存在下で、式(1)の化合物を

- 25 -

トルエン、ナトリウム、ナトリウム等の
溶液中にて炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、ナ
トリウムと等量の硫酸の存在下で式(1)のエステ
ルを硫酸化リンに付することによつて行うことが
出来る。

前項(5)に言うアセチル化は、 N -アセチルホル
ミド等の触媒中で或る量のケトン基とヒドロキ
シル基との反応と反応させることによつて行うことが
出来る。

前項(6)に言う反応は、二酸化炭素等の気相中
でトリメチルアミン等の環基の存在下で式(1)のカル
ボニル化合物を硫酸化リンと反応させることによ
つて行うことが出来る。

前項(6)に言う式(1)のフエノールの代替基のア
セチル化は、酢酸ナトリウム、シリコン、トリメチル
アミン、 α - β -ジウムカルボノールシリコン等の環
基の存在下、硫酸化リン、シリコンカルボニル

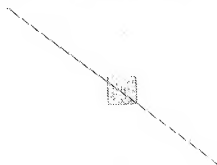
- 26 -

- 25 -

ヒト子宮頸癌細胞 (4×10^4) の細胞液を角
膜ウィルス入り 1×10^3 個のブローチ
(figure) を形成する単位、PDU) と表示し、
検出された試験化合物を含有するマイクロプ
ラストプレートに添加した。既述、この細胞を、
光子中流、1.5%トリプタン溶液内、
1.5% α / β の脱脂ントレプトインをこび
2.5 単位 / ml のマニトリンを含有するイーグル
(Eagle) の最少必要培養地で培養した。ウィルス
による細胞毒性効果 (C, P, B) および細胞毒
性、3.9% の右側培養した後、細胞毒性より
顕著した。試験化合物の抗ウイルス活性 (IC₅₀)
は、対照培養物と比較した時ウイルスC, P, B,
をより劣化する順に示す。細胞毒性は、
毒性の検出が観察されたときの最少濃度 (細胞毒
性値)

- 38 -

試験結果を第1表に示す。本発明の化合物は、
その細胞毒性はより 1.0×10^3 の倍低い異
質で抗腫瘍ウィルス活性を示すことを説明する。
加えて、角膜ウィルスの各種の感染型に対する
1. (エーロウシ-2、ヒドロゲン-2、メ
タキソエール、3- (4-メトキシエール)
-1-プロパノール (化合物A) およびメトキ
シ-2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-
メトキシベンジル) ベンズアミド (化合物B) の
抗ウイルスマニトリンを第2表に示す。



- 39 -

表 1

化 合 物	IC ₅₀ (μg/ml)	細胞毒性 (μg/ml)
1. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
2. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
3. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
4. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
5. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
6. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
7. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
8. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
9. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
10. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
11. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
12. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
13. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
14. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
15. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
16. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
17. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
18. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
19. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
20. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
21. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
22. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
23. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
24. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
25. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
26. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
27. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
28. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
29. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
30. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
31. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
32. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
33. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
34. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
35. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
36. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
37. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
38. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
39. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
40. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
41. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
42. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
43. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
44. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
45. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
46. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
47. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
48. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
49. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0
50. (2-エーロウシ-2-メトキシ-N- (3-メトキシベンジル) ベンズアミド) / (3-メトキシベンジル) ベンズアミド	0.01-0.03	0

表1 第1表

記号	単位	数値	単位
1	1	1	1
2	2	2	2
3	3	3	3
4	4	4	4
5	5	5	5
6	6	6	6
7	7	7	7
8	8	8	8
9	9	9	9
10	10	10	10
11	11	11	11
12	12	12	12
13	13	13	13
14	14	14	14
15	15	15	15
16	16	16	16
17	17	17	17
18	18	18	18
19	19	19	19
20	20	20	20
21	21	21	21
22	22	22	22
23	23	23	23
24	24	24	24
25	25	25	25
26	26	26	26
27	27	27	27
28	28	28	28
29	29	29	29
30	30	30	30
31	31	31	31
32	32	32	32
33	33	33	33
34	34	34	34
35	35	35	35
36	36	36	36
37	37	37	37
38	38	38	38
39	39	39	39
40	40	40	40
41	41	41	41
42	42	42	42
43	43	43	43
44	44	44	44
45	45	45	45
46	46	46	46
47	47	47	47
48	48	48	48
49	49	49	49
50	50	50	50
51	51	51	51
52	52	52	52
53	53	53	53
54	54	54	54
55	55	55	55
56	56	56	56
57	57	57	57
58	58	58	58
59	59	59	59
60	60	60	60
61	61	61	61
62	62	62	62
63	63	63	63
64	64	64	64
65	65	65	65
66	66	66	66
67	67	67	67
68	68	68	68
69	69	69	69
70	70	70	70
71	71	71	71
72	72	72	72
73	73	73	73
74	74	74	74
75	75	75	75
76	76	76	76
77	77	77	77
78	78	78	78
79	79	79	79
80	80	80	80
81	81	81	81
82	82	82	82
83	83	83	83
84	84	84	84
85	85	85	85
86	86	86	86
87	87	87	87
88	88	88	88
89	89	89	89
90	90	90	90
91	91	91	91
92	92	92	92
93	93	93	93
94	94	94	94
95	95	95	95
96	96	96	96
97	97	97	97
98	98	98	98
99	99	99	99
100	100	100	100

- 4 -

表1 第2表

記号	単位	数値	単位
1	1	1	1
2	2	2	2
3	3	3	3
4	4	4	4
5	5	5	5
6	6	6	6
7	7	7	7
8	8	8	8
9	9	9	9
10	10	10	10
11	11	11	11
12	12	12	12
13	13	13	13
14	14	14	14
15	15	15	15
16	16	16	16
17	17	17	17
18	18	18	18
19	19	19	19
20	20	20	20
21	21	21	21
22	22	22	22
23	23	23	23
24	24	24	24
25	25	25	25
26	26	26	26
27	27	27	27
28	28	28	28
29	29	29	29
30	30	30	30
31	31	31	31
32	32	32	32
33	33	33	33
34	34	34	34
35	35	35	35
36	36	36	36
37	37	37	37
38	38	38	38
39	39	39	39
40	40	40	40
41	41	41	41
42	42	42	42
43	43	43	43
44	44	44	44
45	45	45	45
46	46	46	46
47	47	47	47
48	48	48	48
49	49	49	49
50	50	50	50
51	51	51	51
52	52	52	52
53	53	53	53
54	54	54	54
55	55	55	55
56	56	56	56
57	57	57	57
58	58	58	58
59	59	59	59
60	60	60	60
61	61	61	61
62	62	62	62
63	63	63	63
64	64	64	64
65	65	65	65
66	66	66	66
67	67	67	67
68	68	68	68
69	69	69	69
70	70	70	70
71	71	71	71
72	72	72	72
73	73	73	73
74	74	74	74
75	75	75	75
76	76	76	76
77	77	77	77
78	78	78	78
79	79	79	79
80	80	80	80
81	81	81	81
82	82	82	82
83	83	83	83
84	84	84	84
85	85	85	85
86	86	86	86
87	87	87	87
88	88	88	88
89	89	89	89
90	90	90	90
91	91	91	91
92	92	92	92
93	93	93	93
94	94	94	94
95	95	95	95
96	96	96	96
97	97	97	97
98	98	98	98
99	99	99	99
100	100	100	100

- 40 -

一、二、三、四、五

[illegible]

- 42 -

一、總論

化 合 物	分子式	分子量	性状
正丁基醇	$\text{C}_4\text{H}_{10}\text{O}$	74	无色液体，沸点 117.7°C，凝固点 -90°C
正戊基醇	$\text{C}_5\text{H}_{12}\text{O}$	88	无色液体，沸点 138°C，凝固点 -79°C
正己基醇	$\text{C}_6\text{H}_{14}\text{O}$	102	无色液体，沸点 157°C，凝固点 -55°C
正庚基醇	$\text{C}_7\text{H}_{16}\text{O}$	116	无色液体，沸点 176°C，凝固点 -34°C
正辛基醇	$\text{C}_8\text{H}_{18}\text{O}$	130	无色液体，沸点 195°C，凝固点 -15°C
正壬基醇	$\text{C}_9\text{H}_{20}\text{O}$	144	无色液体，沸点 214°C，凝固点 4°C
正癸基醇	$\text{C}_{10}\text{H}_{22}\text{O}$	158	无色液体，沸点 233°C，凝固点 15°C
正十一基醇	$\text{C}_{11}\text{H}_{24}\text{O}$	172	无色液体，沸点 252°C，凝固点 28°C
正十二基醇	$\text{C}_{12}\text{H}_{26}\text{O}$	186	无色液体，沸点 271°C，凝固点 40°C
正十三基醇	$\text{C}_{13}\text{H}_{28}\text{O}$	200	无色液体，沸点 290°C，凝固点 52°C
正十四基醇	$\text{C}_{14}\text{H}_{30}\text{O}$	214	无色液体，沸点 309°C，凝固点 64°C
正十五基醇	$\text{C}_{15}\text{H}_{32}\text{O}$	228	无色液体，沸点 328°C，凝固点 76°C
正十六基醇	$\text{C}_{16}\text{H}_{34}\text{O}$	242	无色液体，沸点 347°C，凝固点 88°C
正十七基醇	$\text{C}_{17}\text{H}_{36}\text{O}$	256	无色液体，沸点 366°C，凝固点 100°C
正十八基醇	$\text{C}_{18}\text{H}_{38}\text{O}$	270	无色液体，沸点 385°C，凝固点 112°C
正十九基醇	$\text{C}_{19}\text{H}_{40}\text{O}$	284	无色液体，沸点 404°C，凝固点 124°C
正二十基醇	$\text{C}_{20}\text{H}_{42}\text{O}$	298	无色液体，沸点 423°C，凝固点 136°C

表 2 続

ウイルス種	10 ¹⁰ 10 ⁹ /ml	
	化合物A	化合物B
腸管ウイルスA	0.01 - 0.03	0.005 - 0.01
	0.03 - 0.09	0.005 - 0.007
	0.01	0.01
	0.03 - 0.037	0.005
	0.1 - 0.3	0.005 - 0.024
	-	0.003
	<0.001	<0.001
	0.004	-
	0.01 - 0.02	-
	0.01 - 0.02	-
腸管ウイルスB	0.01 - 0.02	0.005 - 0.008
	0.01 - 0.02	0.001 - 0.014
	-	0.001 - 0.003
	0.01 - 0.014	0.005 - 0.011
	0.01 - 0.014	0.003
	-	0.003
	0.01 - 0.014	-
	-	0.001
	0.004 - 0.014	0.001
	-	0.001

- 44 -

ヒトウイルス(Hile) 細胞の増殖をより遅く
制する増殖抑制剤は、それぞれ0.01mg/ml(4)
および0.01mg/ml(5)である。

前記したように、式(1)の化合物およびそれらの製
薬学的に許容しうる塩は、ウイルス病、特に普通
感冒に対する薬剤として医薬品の開発物の形で使
用することができる。

製薬学的増殖物は、通常する製薬学的担体と共
に結晶性ウイルス性化合物の少なくとも一種を含
有し、特に、例えば解熱剤、鎮痛剤、抗炎症剤、
抗ヒスタミン剤およびインターフェロン誘導剤等
の他の製薬学的に活性な化合物をも含有すること
ができる。解熱剤は、例えばアスピリン、カプセル
剤、丸剤、錠剤および注射用の結晶性担体、例え
ば、水、生理食塩水、シロップおよびエリキ
ンルを含む懸濁液、または錠剤投与用の糖衣片、例え
ば、硬質錠剤、緩衝錠剤または泡液等の非錠剤投与用

の製剤、ならびに例えば懸濁液、泡液、微粉末、
砂剤、急凍剤、フロースおよびエフロンの同
所投与用の製剤を含む。

前記製薬学的増殖物は、活性成分の濃度が指薬
の対象となる特定のウイルス感染に対しても最少固
止濃度より大となるように投与することができる
ようなものである。

投与のための投与量は、投与経路、年齢、体重
および患者の状態、ならびに治療すべき特定の病
患に応じて決まる。一般に、成人については、普通
感冒に使用するための投与量は、例えば経口投与
の場合、約100mg〜2000mg、1日3〜6回で
あり、局所適用の場合、約0.1〜100mg/ml、
1日3〜6回である。

第1頁の続き

Serial. Cl.)	識別記号	序内整理番号
C 07 C 69/035		6556-4H
69/06		7055-4H
103/75		7375-4H
131/06		7162-4H
149/32		7162-4H
151/09		7142-4H
153/05		7142-4H
161/00		7142-4H
C 07 D 207/233		7242 4C
213/40		7135-4C
307/46		7043-4C
317/54		7432-4C
317/58		7432-4C
333/14		6586-4C
C 07 F 9/12		7311-4H
C 07 H 15/20		7252-4C

発 明 者	梅田 勉
	横浜市神奈川区六角橋4-4-20ハイッ白雲204
発 明 者	大塚達男
	鎌倉市上町屋615
発 明 者	石塚秀夫
	横浜市戸塚区桂町1番地11号405
発 明 者	須藤康次
	横浜市戸塚区伊勢町1403番地1 リームハイッ9棟506号

優先権主張 ④1981年10月5日④イギリス

(GB)④8130001

発 明 者 藤生守男

藤沢市藤沢3768-3 善行団地5

-7-203